

## PR-93

СИНТЕЗ 4-АМИНОПИРАЗОЛ-3-ОЛОВ  
И ИХ АНТИРАДИКАЛЬНАЯ АКТИВНОСТЬ

**Н. А. Агафонова<sup>1</sup>, Е. В. Щегольков<sup>1</sup>, Г. Ф. Махаева<sup>2</sup>, Е. В. Рудакова<sup>2</sup>,  
Я. В. Бургарт<sup>1</sup>, В. И. Салоутин<sup>1</sup>**

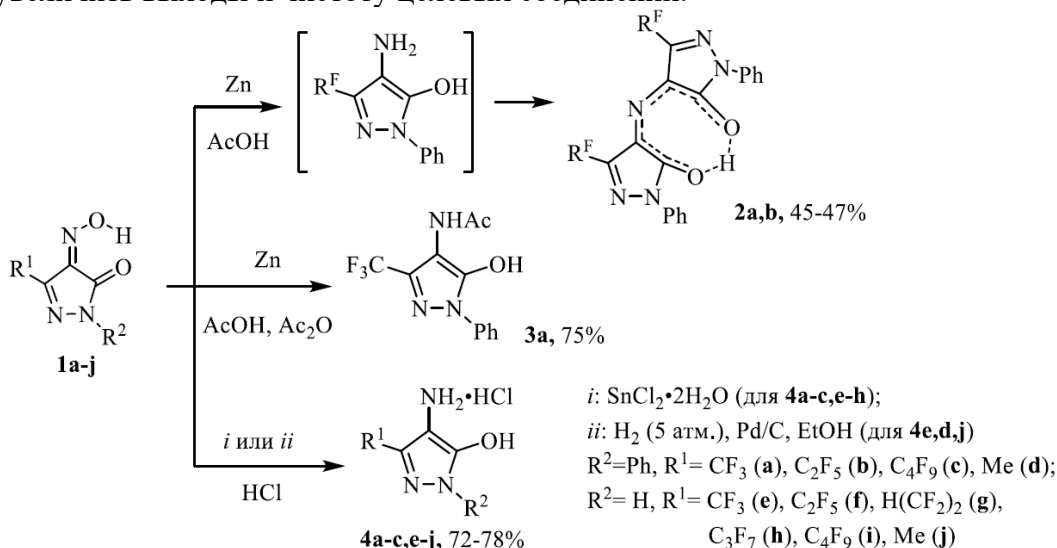
<sup>1</sup>Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского, УрО РАН,  
620990, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 20/22;

<sup>2</sup>Институт физиологически активных веществ РАН,  
142432, Россия, Московская обл., г. Черноголовка, Северный проезд, 1.

E-mail: nna@ios.uran.ru

Пиразольное ядро считается уникальным фармакофором для конструирования перспективных антиоксидантов<sup>1</sup>. Одним из мощных антиоксидантов, применяемых в качестве медикамента, является *эдаравон* (3-метил-1-фенил-2-пиразолин-5-он).

Нами получены новые 4-аминозамещенные аналоги *эдаравона*, включая полифторалкилсодержащие производные, и изучены их антиоксидантные свойства. При этом найдено, что восстановление 4-гидроксииминопиразолонов **1a,b** цинком в уксусной кислоте не приводит к образованию соответствующих аминопроизводных, поскольку в этом случае выделены бис[5-гидрокси-1-фенил-3-(полифторалкил)-1*H*-пиразол-4-ил]-имины **2a,b**. Добавление в восстановительную систему уксусного ангидрида позволило получить 4-ацетиламинопиразол-3-ол **3a**. Гидрохлориды 4-аминопиразол-5-олов **4a-j** синтезированы при использовании двух способов восстановления гидроксииминной группы в 4-гидроксииминопиразол-3-онах **1a-h**: под действием SnCl<sub>2</sub> в HCl и водородом под давлением в присутствии Pd/C и HCl в этаноле. Второй способ позволяет увеличить выходы и чистоту целевых соединений.



Гидрохлориды 4-аминопиразол-5-олов **4e-j**, имеющих *NH*-фрагмент, проявили антиоксидантную активность от хороших до высоких значений в ABTS (TEAC 0.45...0.92) и FRAP (0.62...0.88 ед.) тестах. Снижение активности наблюдалось с удлинением полифторалкильного заместителя, а при введении фенильного заместителя к атому азота умеренную активность проявил только CF<sub>3</sub>-пиразолол **4a** (TEAC 0.75, 0.89 ед.).

**Библиографический список**

1. Silva V.L.M. *Current progress on antioxidants incorporating the pyrazole core* / V.L.M. Silva, J. Elguero, A.M.S. Silva // *European Journal of Medicinal Chemistry*. – 2018. – Vol. 156. – P. 394–429.